#### 庁 許 本 日

OFFICE PATENT JAPAN

REC'L 25 JUL 2003

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書 いる事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office

出願年月日

Date of Application:

2002年 7月17日

出願番 Application Number:

特願2002-208059

[ ST.10/C ]:

[JP2002-208059]

人 Applicant(s):

住友化学工業株式会社

COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2003年 3月28日

特許庁長官 Commissioner, Japan Patent Office



# 特2002-208059

【書類名】

特許願

【整理番号】

P154643

【提出日】

平成14年 7月17日

【あて先】

特許庁長官殿

【国際特許分類】

A01N 37/34

A01N 43/40

C07C255/04

C07D213/02

【発明者】

【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会

社内

【氏名】

大高 健

【発明者】

【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会

社内

【氏名】

大平 大輔

【発明者】

【住所又は居所】

兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会

社内

【氏名】

高岡 大介

【特許出願人】

【識別番号】

000002093

【氏名又は名称】

住友化学工業株式会社

【代理人】

【識別番号】

100093285

【弁理士】

【氏名又は名称】

久保山 隆

【電話番号】

06-6220-3405

# 特2002-208059

# 【選任した代理人】

【識別番号】 10009

100094477

【弁理士】

【氏名又は名称】 神野 直美

【電話番号】

06-6220-3405

【選任した代理人】

【識別番号】

100113000

【弁理士】

【氏名又は名称】 中山 亨

【電話番号】

06-6220-3405

【選任した代理人】

【識別番号】

100119471

【弁理士】

【氏名又は名称】 榎本 雅之

【電話番号】

06-6220-3405

【手数料の表示】

【予納台帳番号】

010238

【納付金額】

21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】

明細書 1

【物件名】

要約書

【包括委任状番号】 0109029

【プルーフの要否】 要

【書類名】

明細書

【発明の名称】

マロノニトリル化合物及びその用途

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

$$(R^5)_n \xrightarrow{R^1 \quad R^2 \quad R^3} R^4 \qquad (1)$$

「式中、

 $R^1$ は、 $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルケニル基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルキニル基、または水素原子を表す。

 $R^2$ は、 $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基、 $C1\sim C5$  (ハロ) アルキルオキシ基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルケニル基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルキニル基、水素原子またはシアノ基を表す。

 $R^3$ 及び $R^4$ は、同一または相異なり、各々C1~C6(ハロ)アルキル基、C2~C6(ハロ)アルケニル基、C2~C6(ハロ)アルキニル基、C3~C6(ハロ)シクロアルキル基、C4~C6(ハロ)シクロアルケニル基若しくは水素原子を表すか、又は $R^3$ と $R^4$ とが一緒になってC2~C6(ハロ)アルキレン基またはC4~C6(ハロ)アルケニレン基を表す。

R<sup>5</sup>は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1~C4 (ハロ) アルキル基、C2~C4 (ハロ) アルケニル基、C2~C4 (ハロ) アルキニル基、C1~C 4 (ハロ) アルキルオキシ基、C1~C4 (ハロ) アルキルスルフィニル基、C1~C4 (ハロ) アルキルスルフィニル基、C1~C4 (ハロ) アルキルスルホニル基、C2~C4 (ハロ) アルキルカルボニル基、C2~C4 (ハロ) アルキルオキシカルボニル基、C2~C4 (ハロ) アルキルカルボニルオキシ基、フェニルオキシ基またはフェニルチオ基(前記フェニルオキシ基及びフェニルチオ基は、ハロゲン原子またはC1~C3アルキル基で置換されていてもよい。) を表す。

nは $0\sim4$ の任意の整数を表す。nが2以上の場合、 $R^5$ は同一でも相異なっていてもよい。]

で示されるマロノニトリル化合物。

#### 【請求項2】

請求項1記載のマロノニトリル化合物を有効成分として含有することを特徴と する有害生物防除剤。

#### 【請求項3】

請求項1記載のマロノニトリル化合物の有効量を有害生物または有害生物の生 息場所に施用することを特徴とする有害生物の防除方法。

# 【発明の詳細な説明】

[00.01]

【発明の属する技術分野】

本発明は、マロノニトリル化合物及びその用途に関する。

[0002]

【従来の技術および発明が解決しようとする課題】

従来より、有害生物の防除を目的として種々の有害生物防除剤が用いられているが、その効力は必ずしも十分でない場合があり、新しい十分な効力を有する有害生物防除剤の開発が望まれている。

本発明は、有害生物防除活性を有する新規な化合物及びその化合物の有害生物防除用途を提供することを課題とする。

[0003]

# 【課題を解決するための手段】

本発明者等は、優れた有害生物防除活性を有する化合物を見出すべく鋭意検討を重ねた結果、下記式(I)で示されるマロノニトリル化合物が有害昆虫類並びに有害ダニ類等の有害節足動物類及び有害線虫類等の有害生物に対して優れた防除活性を有することを見出し本発明に至った。

即ち、本発明は、式(I)

$$(R^5)_n \xrightarrow{R^1 \quad R^2 \quad R^3} R^4 \qquad (1)$$

[式中、

 $R^1$ は、 $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルケニル基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルキニル基、または水素原子を表す。

 $R^2$ は、 $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基、 $C1\sim C5$  (ハロ) アルキルオキシ基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルケニル基、 $C2\sim C5$  (ハロ) アルキニル基、水素原子またはシアノ基を表す。

 $R^3$ 及び $R^4$ は、同一または相異なり、各々 $C1\sim C6$ (ハロ)アルキル基、 $C2\sim C6$ (ハロ)アルケニル基、 $C2\sim C6$ (ハロ)アルキニル基、 $C3\sim C6$ (ハロ)シクロアルキル基、 $C4\sim C6$ (ハロ)シクロアルケニル基若しくは水素原子を表すか、又は $R^3$ と $R^4$ とが一緒になって $C2\sim C6$ (ハロ)アルキレン基または $C4\sim C6$ (ハロ)アルケニレン基を表す。

 $R^5$ は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキル基、 $C2\sim C4$  (ハロ) アルケニル基、 $C2\sim C4$  (ハロ) アルキニル基、 $C1\sim C$  4 (ハロ) アルキルオキシ基、 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキルスルフィニル基、 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキルスルフィニル基、 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキルスルホニル基、 $C2\sim C4$  (ハロ) アルキルカルボニル基、 $C2\sim C4$  (ハロ) アルキルカルボニル基、 $C2\sim C4$  (ハロ) アルキルカルボニルオキシ基カルボニル基、 $C2\sim C4$  (ハロ) アルキルカルボニルオキシ基、フェニルオキシ基またはフェニルチオ基(前記フェニルオキシ基及びフェニルチオ基は、ハロゲン原子または $C1\sim C3$  アルキル基で置換されていてもよい。)を表す。  $C1\sim C4$  の任意の整数を表す。 $C1\sim C4$  の場合、 $C1\sim C4$  の任意の整数を表す。 $C1\sim C4$  の日意の整数を表す。 $C1\sim C4$  の日意のを表す。 $C1\sim C4$  の日本を表す。 $C1\sim C4$  の

いてもよい。] で示されるマロノニトリル化合物(以下、本発明化合物と記す)、本発明化合物 を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤及び本発明化合物の 有効量を有害生物の生息場所に施用することを特徴とする有害生物の防除方法に

[0004]

関する。

【発明の実施の形態】

本発明において、

(ハロ) アルキル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルキル基を意味し、

- (ハロ) アルキルオキシ基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で 置換されていてもよいアルキルオキシ基を意味し、
- (ハロ) アルケニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルケニル基を意味し、
- (ハロ) アルキニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルキニル基を意味し、
- (ハロ)シクロアルキル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で 置換されていてもよいシクロアルキニル基を意味し、
- (ハロ)シクロアルケニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子 で置換されていてもよいシクロアルケニル基を意味し、
- (ハロ) アルキレン基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換 されていてもよいアルキレン基を意味し、
- (ハロ) アルケニレン基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルケニレン基を意味し、
- (ハロ) アルキルチオ基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルチオ基を意味し、
- (ハロ) アルキルスルフィニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルスルフィニル基を意味し、
- (ハロ) アルキルスルホニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルスルホニル基を意味し、
- (ハロ) アルキルカルボニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロゲン原子で置換されていてもよいアルキルカルボニル基を意味し、
- (ハロ) アルキルオキシカルボニル基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロ ゲン原子で置換されていてもよいアルキルオキシカルボニル基を意味し、
- (ハロ) アルキルカルボニルオキシ基とは水素原子の1つまたは2つ以上がハロ ゲン原子で置換されていてもよいアルキルカルボニルオキシ基を意味する。
  - また、C1~C6等の記載は、各置換基を構成する全炭素数を意味する。

[0005]

本発明化合物において、

 $R^1$ で示される $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基としては例えばメチル基、エチル基、プロピル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、クロロメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基及び1, 1, 2, 2--テトラフルオロエチル基が挙げられ、

 $C2\sim C5$  (ハロ) アルケニル基としては例えばビニル基、2, 2-ジフルオロビニル基、1, 2, 2-トリフルオロビニル基、1-プロペニル基及び2-プロペニル基が挙げられ、

 $C2\sim C5$  (ハロ) アルキニル基としては例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基及び3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基が挙げられる。

# [0006]

 $R^2$ で示される $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基としては例えばメチル基、エチル基、プロピル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、クロロメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフロロエチル基及び1, 1, 2, 2--テトラフルオロエチル基が挙げられ、

C1~C5 (ハロ) アルキルオキシ基としては例えばメトキシ基、エトキシ基、 1-メチルエトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2, 2,2-トリフルオロエトキシ基及び1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ 基が挙げられ、

 $C2\sim C5$  (ハロ) アルケニル基としては例えばビニル基、2, 2-ジフルオロビニル基、1, 2, 2-トリフルオロビニル基、1-プロペニル基及び2-プロペニル基が挙げられ、

C2~C5 (ハロ) アルキニル基としては例えばエチニル基、1ープロピニル基 、2ープロピニル基及び3,3,3ートリフルオロー1ープロピニル基が挙げら れる。

# [0007]

 $R^3$ または $R^4$ で示されるC1~C6(ハロ)アルキル基としては例えばメチル

基、エチル基、1ーメチルエチル基、2ーメチルプロピル基、プロピル基、ブチル基、3ーメチルブチル基、3,3ージメチルブチル基、2,2ージスチルプロピル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、2,2ージフルオロエチル基、2,2ージクロロエチル基、3,3ージフルオロプロピル基、3,3ージクロロプロピル基、トリクロロメチル基、2,2,2ートリフルオロエチル基、2,2,2ートリフルオロエチル基、2,2,2ートリフルオロプロピル基、3,3,3ートリクロロプロピル基、2,2ージフルオロプロピル基、3,3,3ージフルオロブチル基、ペンタフルオロエチル基、2,2,3,3,3ーペンタフルオロプロピル基、1,1,2,2ーテトラフルオロエチル基及び2,2,3,3ーテトラフルオロプロピル基が挙げられ、

C2~C6(ハロ)アルケニル基としては例えばビニル基、アリル基、1ープロ ペニル基、3-ブテニル基、2-メチル-1-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、3-メチル-3-ブテニル 基、4-メチル-3-ペンテニル基、1-クロロビニル基、2-クロロビニル基 、1-フルオロビニル基、2-フルオロビニル基、2,2-ジクロロビニル基、 2, 2-ジブロモビニル基、2, 2-ジフルオロビニル基、1, 2, 2-トリフ ルオロビニル基、1-(トリフルオロメチル)ビニル基、2-クロロ-2-プロ ペニル基、3-クロロ-2-プロペニル基、2-フルオロ-2-プロペニル基、 3-フルオロ-2-プロペニル基、3,3-ジクロロ-2-プロペニル基、3, 3-ジブロモ-2-プロペニル基、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル基、2, 3,3-トリフルオロー2-プロペニル基、2-(トリフルオロメチル)-2-プロペニル基、2,3,3,3ーテトラフルオロー1ープロペニル基、1,2, 3,3,3-ペンタフルオロー1-プロペニル基、3,4,4-トリフルオロー 3-ブテニル基、3,4,4,4-テトラフルオロ-2-ブテニル基、2,3, 4, 4, 4ーペンタフルオロー2ーブテニル基及び4, 5, 5ートリフルオロー 4 -ペンテニル基が挙げられ、

C2~C6(ハロ)アルキニル基としては例えばエチニル基、1ープロピニル基、2ープロピニル基、1ーブチニル基、3ーメチルー1ーブチニル基、3,3ージメチルー1ーブチニル基、2ークロロー1ープロピニル基、3ークロロー2ー

プロピニル基、3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル基及び4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基が挙げられ、

 $C3\sim C6$  (ハロ) シクロアルキル基としては例えばシクロプロピル基、2, 2 ージクロロー1 ーシクロプロピル基、2, 2 ージフルオロー1 ーシクロプロピル基、2, 2 ージフルオロー1 ーシクロプロピル基、2, 2 ージフルオロー1 ーシクロブチル基、2, 2 ージフルオロー1 ーシクロブチル基、2, 2 ージフルオロー1 ーシクロブチル基、2, 2 ル基及びシクロヘキシル基があげられ、

C4~C6(ハロ)シクロアルケニル基としては例えば2-フルオロー2-シクロペンテニル基があげられる。

[0008]

 $R^3$ 及び $R^4$ とが一緒になって示されるC2-C6(ハロ)アルキレン基としては例えば、エチレン基、プロピレン基、トリメチレン基及びテトラメチレン基が挙げられ、

C4-C6 (ハロ) アルケニレン基としては例えば2-ブテニレン基及び2-ペンテニレン基が挙げられる。

[0009]

 $R^5$ で示されるハロゲン原子としては例えばフッ素原子、塩素原子及び臭素原子が挙げられ、

 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキル基としては例えばメチル基、エチル基、プロピル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基及び1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基が挙げられ、

C2~C4(ハロ)アルケニル基としては例えばビニル基、1-プロペニル基、

2-プロペニル基及び2,2-ジフルオロビニル基が挙げられ、

C2~C4 (ハロ) アルキニル基としては例えばエチニル基、1ープロピニル基 、2ープロピニル基及び3,3,3ートリフルオロー1ープロピニル基が挙げら れ、

C1~C4(ハロ)アルキルオキシ基としては例えばメトキシ基、エトキシ基、

プロポキシ基、トリフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基, クロロジフルオロメトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2, 2-トリフルオロエトキシ基及び1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基が挙げられ、

 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキルチオ基としては例えばメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基及び1, 1, 2, 2、ーテトラフルオロエチルチオ基が挙げられ、

C1~C4(ハロ)アルキルスルフィニル基としては例えばメチルスルフィニル 基及びトリフルオロメチルスルフィニル基が挙げられ、

 $C1\sim C4$  (ハロ) アルキルスルホニル基としては例えばメチルスルホニル基及 びトリフルオロメチルスルホニル基が挙げられ、

C2~C4(ハロ)アルキルカルボニル基としては例えばアセチル基、プロピオニル基及びトリフルオロアセチル基が挙げられ、

C2~C4(ハロ)アルキルオキシカルボニル基としては例えばメトキシカルボニル基及び2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル基が挙げられ、

C2~C4(ハロ)アルキルカルボニルオキシ基としては例えばアセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基及びトリフルオロアセチルオキシ基が挙げられ、

ハロゲン原子または $C1\sim C3$  アルキル基で置換されていてもよいフェニルオキシ基としては例えばフェノキシ基、p-メチルフェノキシ基、m-メチルフェノキシ基及びp-クロロフェノキシ基が挙げられ、

ハロゲン原子またはC1~C3アルキル基で置換されていてもよいフェニルチオ基としては例えばフェニルチオ基、p-メチルフェニルチオ基、m-メチルフェニルチオ基及びp-クロロフェニルチオ基が挙げられる。

# [0010]

本発明化合物の態様としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

- 式 (I) において、 $R^1$ が水素原子であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^2$ がメチル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^1$ 及び $R^2$ が水素原子であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^1$ が水素原子であり $R^2$ がメチル基であるマロノニトリル化

#### 合物;

- 式(I)において、 $R^3$ が水素原子であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、R $^4$ がC2~C6アルケニル基であるマロノニトリル化合物:
- 式 (I) において、 $R^4$ がビニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2ープロペニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ がC2 $\sim$ C6ハロアルケニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2,2-ジフルオロビニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^4$ が1-(トリフルオロメチル)ビニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が3, 3-ジフルオロ-2-プロペニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2, 3, 3ートリフルオロー2ープロペニル基である マロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が3, 3, 3ートリフルオロー1ープロペニル基である マロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が $C2\sim C6$  ハロアルキニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が $C1\sim C6$  フルオロアルキル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^4$ がフルオロメチル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2, 2-ジフルオロエチル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2, 2, 2-トリフルオロエチル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^4$ がペンタフルオロエチル基であるマロノニトリル化合物

- 式 (I) において、 $R^4$ が3,3,3ートリフルオロプロピル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2, 2, 3, 3, 3ーペンタフルオロプロピル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が $C3\sim C6$ シクロアルキル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^4$ が2、2-ジクロロシクロプロピル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^4$ がシクロプロピル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^4$ がシクロブチル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がビニル基又は 2-プロペニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ が2,2-ジフルオロビニル基、 1- (トリフルオロメチル) ビニル基、 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニル基、 2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニル基又は 3, 3, 3-トリフルオロ -1-プロペニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル基、3, 3-トリフルオロプロピル基又は2, 2, 3, 3-ペンタフルオロプロピル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がシクロプロピル基、シクロブチル基又は 2 , 2 ジクロロシクロプロピル基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がビニル基又は2-プロペニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ が2, 2-ジフルオロビニル基、1- (トリフルオロメチル) ビニル基、3, 3-ジフルオロー2-プロペニル基、2, 3, 3-トリフルオロー2-プロペニル基又は3, 3, 3-トリフルオロー1-プロペニル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、 $R^1$ 及び $R^3$ が水素原子であり、 $R^2$ がメチル基であり、 $R^4$ が

2, 2-ジフルオロビニル基又は1-(トリフルオロメチル)ビニル基、3, 3 -ジフルオロ-2-プロペニル基、2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニル 基又は3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロペニル基であるマロノニトリル化合物;

式(I)において、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がフルオロメチル基、2, 2 – ジフルオロエチル基、2, 2 – トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、3, 3, 3 – トリフルオロプロピル基又は2, 2, 3, 3, 3 – ペンタフルオロプロピル基であるマロノニトリル化合物;

式 (I) において、 $R^1$ 及び $R^3$ が水素原子であり、 $R^2$ がメチル基であり、 $R^4$ がフルオロメチル基、2, 2 – ジフルオロエチル基、2, 2 – トリフルオロエチル基、3, 3 – トリフルオロプロピル基又は 2, 2, 3, 3, 3 – ペンタフルオロプロピル基であるマロノニトリル化合物;

式(I)において、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がシクロプロピル基、シクロブチル基又は2, 2 - ジクロロシクロプロピル基であるマロノニトリル化合物;

- 式 (I) において、 $R^5$ がトリフルオロメチル基であるマロノニトリル化合物;
- 式(I)において、R<sup>5</sup>がシアノ基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^5$ がニトロ基であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^5$ が臭素原子であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^5$ が塩素原子であるマロノニトリル化合物;
- 式 (I) において、 $R^5$ がフッ素原子であるマロノニトリル化合物。

[0011]

次に本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物は例えば、以下の(製造法1)~(製造法5)にしたがって製造することができる。

[0012]

(製造法1)

化合物(a)と化合物(b)とを反応させる方法

$$(R^{5})_{n} \xrightarrow{R^{1} R^{2}} \frac{Z^{1} R^{4}}{(b)} (R^{5})_{n} \xrightarrow{R^{1} R^{2} R^{3}} R^{4}$$

$$(a) \qquad \qquad (I)$$

[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 及びnは前記と同じ意味を表し、 $Z^1$ はハロゲン原子、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基又はトルエンスルホニル基を表す。]

該反応は通常溶媒中、塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばN, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の有機硫黄類、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びそれらの混合物があげられる

該反応にいられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、カリウムー t ーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド、リチウムジイソプロピルアミドなどのアルカリ金属アミド類及びジメチルアミノピリジン、1,4ージアザビシクロ[2.2.2]オクタン、1,8ージアザビシクロ[5.4.0]ー7ーウンデセン等の有機塩基があげられる。反応に用いられる塩基の量は、化合物(a)1モルに対して通常1~10モルの割合である。

反応に供される化合物 (b) の量は、化合物 (a) 1 モルに対し、通常  $1\sim 1$  0 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(I)で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式(I)で示される本発明化合物は必要に応じてクロマト

グラフィー、再結晶等で精製することもできる。

[0013]

#### (製造法2)

化合物(c)と化合物(d)とを反応させる方法

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & R^2 \\
R^3 & (R^5)_n & Z^2 \\
\hline
NC & CN & Base & (R^5)_n & R^1 & R^2 & R^3 \\
\hline
NC & CN & (C) & (C) & (C) & (C) & (C) & (C) \\
\hline
R^1 & R^2 & R^3 & (R^5)_n & (R^5)_n & (R^5)_n & (C) & (C) & (C) \\
\hline
NC & CN & (C) & (C)$$

[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 及びnは前記と同じ意味を表し、Z2はハロゲン原子、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基又はトルエンスルホニル基を表す。]

該反応は通常溶媒中、塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばN, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の有機硫黄類、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びそれらの混合物があげられる

該反応で用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、カリウムー t ーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド、リチウムジイソプロピルアミドなどのアルカリ金属アミド類及び4ージメチルアミノピリジン、1,4ージアザビシクロ[2.2.2]オクタン、1,8ージアザビシクロ[5.4.0]-7ーウンデセン等の有機塩基があげられる。反応に用いられる塩基の量は、化合物(c)1モルに対して通常1~10モルの割合である。

反応に供される化合物(d)の量は、化合物(c) 1 モルに対し、通常  $1\sim 1$  0 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常1~

24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(I)で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式(I)で示される本発明化合物は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等で精製することもできる。

[0014]

化合物(a)は、例えば下記スキームで示されるルートにしたがって製造することができる。

$$(R^{5})_{n} \xrightarrow{\mathbb{R}^{1}} CN \xrightarrow{R^{1}} CN \xrightarrow{\mathbb{R}^{2}} CN \xrightarrow{\mathbb{R}^{5}} NC CN$$

$$(e) \qquad \qquad (f) \qquad \qquad (a)$$

[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 及びnは前記と同じ意味を表す。)

(第1工程)

化合物 (f) は化合物 (e) とマロノニトリルとを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒中、塩基の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては例えばN,N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類及びそれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化テトラブチルアンモニウム等が挙げられる。反応に用いられる塩基の量は、化合物(e)1モルに対して通常0.01~0.5モルの割合である。

反応に用いられるマロノニトリルの量は、化合物(e) 1 モルに対して、通常 1~10 モルの割合である。

該反応の反応温度は、通常-20~200℃の範囲であり、反応時間は、通常 1~24時間の範囲である。 該反応は、必要により反応によって生成する水を反応系外に除きながら行うこともできる。 ・

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (f) を単離することができる。単離した化合物 (f) は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等で精製することもできる。

[0015]

(第2工程)

(1) R<sup>2</sup>が水素原子、シアノ基以外の置換基を表す場合

化合物(a)は化合物(f)と有機金属化合物とを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒中、必要に応じて銅塩の存在下に行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる有機金属化合物としては、例えばヨウ化メチルマグネシウム、臭化エチルマグネシウム、臭化イソプロピルマグネシウム、臭化ビニルマグネシウム、臭化エチニルマグネシウム、ジメチルマグネシウム等の有機マグネシウム化合物、メチルリチウム等の有機リチウム化合物、ジエチル亜鉛等の有機亜鉛化合物、トリフルオロメチル飼等の有機飼化合物が挙げられる。反応に用いられる有機金属化合物の量は化合物(f)1モルに対して通常1~10モルの割合である。

反応に用いられる銅塩としては例えばヨウ化銅(I)、臭化銅(I)等が挙げられる。反応に用いられる銅塩の量は化合物(f) 1 モルに対して通常 1 モル以下である。

該反応の反応温度は通常-20~100℃の範囲であり、反応時間通常1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等 の後処理操作を行うことにより、化合物 (a) を単離することができる。単離し た化合物(a)は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等で精製することもできる。

[0016]

# (2) R<sup>2</sup>が水素原子を表す場合

化合物 (a) は化合物 (f) を還元反応に付することにより製造することができる。

該還元反応は通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、水及びそれらの混合物が挙げられる

反応に用いられる還元剤としては例えば水素化ホウ素ナトリウムが挙げられる。反応に用いられる還元剤の量は、化合物(f)1モルに対して通常0.25~2モルの割合である。

該反応の反応温度は通常 0~50℃の範囲であり、反応時間は通常瞬時~24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (a) を単離することができる。単離した化合物 (a) は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等で精製することもできる。

[0017]

# (3) $R^2$ がシアノ基を表す場合

化合物(a)は化合物(f)とシアン化物とを反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるシアン化物としては、例えばテトラブチルアンモニウムシア

ニドが挙げられる。反応に用いられるシアン化物の量は化合物(f) 1 モルに対して通常  $1\sim 1$  0 モルの割合である。

該反応の反応温度の通常-20~100℃の範囲であり、反応時間通常1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の後処理操作を行い、化合物(a)を単離することができる。単離した化合物(a)は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等で精製することもできる。

#### (製造法3)

本発明化合物のうち、 $R^2$ が $C1\sim C5$  (ハロ) アルキル基であり、 $R^1$ および  $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がビニル基である化合物は、下式に示される方法によっても製造することができる。

[式中、 $R^5$ 及びnは前記と同じ意味を表し、 $R^{21}$ は $C_1\sim C_5$ (ハロ)アルキル基を表し、 $B_u$ はブチル基を意味し、 $A_{IBN}$ とはアゾビスイソブチロニトリルを意味する。]

(k)

該反応はJ. Am. Chem. Soc., 110, 1289 (1988) に記載の方法に準じて行うことができる。

#### (製造法4)

本発明化合物のうち、 $R^2$ がシアノ基であり、 $R^1$ および $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がビニル基である化合物は、下式に示される方法によっても製造すること

ができる。

[式中、 $R^5$ 及びnは前記と同じ意味を表す。dbaはジベンジリデンアセトンを意味し、dppfは1, 1'ービス(ジフェニルフォスフィノ)フェロセンを意味する。]

該反応はTetrahedron Lett., 41, 2911 (2000) に記載の条件に準じて行うことができる。

[0020]

#### (製造法5)

本発明化合物のうち、 $R^2$ がC  $1\sim C$  5 ( ) アルキルオキシ基であり、 $R^1$  および $R^3$ が水素原子であり、 $R^4$ がビニル基である化合物は、下式に示される方法によっても製造することができる。

$$(R^{5})_{n}$$
 $(h)$ 
 $(h$ 

[式中、 $R^5$ 及びnは前記と同じ意味を表し、 $R^{22}$ は $C_1\sim C_5$ (ハロ)アルキルオキシ基を表す。 $P_1$ はフェニル基を意味し、 $T_1$  HFはテトラヒドロフランを意味する。

該反応はJ. Am. Chem. Soc., 120, 6838 (1998) に記

載の条件に準じて行うことができる。

[0021]

本発明化合物が防除効力を示す有害生物としては、例えば有害昆虫類並びに有害が二類等の有害節足動物類及び有害線虫類が挙げられる。より具体的には例えば下記のものが挙げられる。

半翅目害虫:ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ (Ni laparvata lugens)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、タイワンツマグロヨコバイ (Nephotettix virescens)等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (Aphis gossypii)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (Ne zara antennata)、ホソヘリカメムシ (Riptortus clavetus)、オオトゲシラホシカメムシ (Eysarcoris lewisi)、トゲシラホシカメムシ (Eysarcoris parvus)、チャバネアオカメムシ (Plautia stali)、クサギカメムシ (Halyomorpha mista)等のカメムシ類、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、シルバーリーフコナジラミ (Bemisia argentifolii)等のコナジラミ類、アカマルカイガラムシ (Aonidiella aurantii)、サンホーゼカイガラムシ (Comstocka spis perniciosa)、シトラススノースケール (Unaspis citri)、ルビーロウムシ (Ceroplastes rubens)、イセリヤカイガラムシ (Icerya purchasi)等のカイガラムシ類、グンバイムシ類、キジラミ類等。

[0022]

鱗翅目害虫: ニカメイガ (Chilo suppressalis) 、コブノメイガ (Cnaphalocroc is medinalis) 、ワタノメイガ (Notarcha derogata) 、ノシメマダラメイガ (Plodia interpunctella) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura) 、アワヨトウ (Pseudaletia separata) 、トリコプルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属等のヤガ類、モンシロチョウ (Pieris rapae) 等のシロチョウ類 、アドキソフィエス属、ナシヒメシンクイ (Grapholita molesta) 、コドリンガ (Cydia pomonella) 等のハマキガ類、モモシンクイガ (Carposina niponensis ) 等のシンクイガ類、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユープロクティス属等のドクガ類、コナガ (Plutella xylostella) 等のスガ類、ワ

タアカミムシ (Pectinophora gossypiella) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (Hyphantria cunea) 等のヒトリガ類、イガ (Tinea translucens) 、コイガ (Tineola bisselliella) 等のヒロズコガ類等。

[0023]

双翅目害虫:アカイエカ (Culex pipiens pallens)、コガタアカイエカ (Culex tritaeniorhynchus)、ネッタイイエカ (Culex quinquefasciatus)等のイエカ類、ネッタイシマカ (Aedes aegypti)、ヒトスジシマカ (Aedes albopictus)等のエーデス属、(Anopheles sinensis)等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (Musca domestica)、オオイエバエ (Muscina stabulans)等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ (Delia platura)、タマネギバエ (Delia antiqua)等のハナバエ類、ミバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、ブユ類、アブ類、サシバエ類、ハモグリバエ類等。

[0024]

鞘翅目害虫:ウエスタンコーンルートワーム (Diabrotica virgifera virgifera )、サザンコーンルートワーム (Diabrotica undecimpunctata howardi) 等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ (Anomala cuprea)、ヒメコガネ (Anomala rufocuprea) 等のコガネムシ類、メイズウィービル (Sitophilus zeamais)、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus)、アズキゾウムシ (Calloso bruchuys chienensis) 等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ (Tribolium castaneum) 等のゴミムシダマシ類、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、ウリハムシ (Aulacophora femoralis)、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata)、コロラドハムシ (Leptinota rsa decemlineata) 等のハムシ類、シバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ (Epilachna vigintioctopunctata) 等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ類、ナガシンクイムシ類、カミキリムシ類、アオバアリガタハネカクシ (Paederus fuscipes) 等。

[0025]

ゴキブリ目害虫:チャバネゴキブリ (Blattella germanica) 、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa) 、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana) 、トビイ

ロゴキブリ (Periplaneta brunnea) 、トウヨウゴキブリ (Blatta orientalis) 等。

[0026]

アザミウマ目害虫:ミナミキイロアザミウマ (Thrips palmi) 、ネギアザミウマ (Thrips tabaci) 、ミカンキイロアザミウマ (Frankliniella occidentalis) 、ヒラズハナアザミウマ (Frankliniella intonsa) 等。

膜翅目害虫:アリ類、スズメバチ類、アリガタバチ類、ニホンカブラバチ (Atha lia japonica) 等のハバチ類等。

[0027]

直翅目害虫:ケラ類、バッタ類等。

隠翅目害虫:ネコノミ (Ctenocephalides felis)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheop is) 等。

シラミ目害虫:コロモジラミ (Pediculus humanus corporis)、ケジラミ (Phth irus pubis)、ウシジラミ (Haematopinus eurysternus)、ヒツジジラミ (Dalma linia ovis) 等。

シロアリ目害虫:ヤマトシロアリ (Reticulitermes speratus)、イエシロアリ (Coptotermes formosanus) 等。

[0028]

ダニ目害虫:ナミハダニ (Tetranychus urticae) 、カンザワハダニ (Tetranych us kanzawai) 、ミカンハダニ (Panonychus citri) 、リンゴハダニ (Panonychu s ulmi) 、オリゴニカス属等のハダニ類、ミカンサビダニ (Aculops pelekassi ) 、リンゴサビダニ (Aculus schlechtendali) 等のフシダニ類、チャノホコリダニ (Polyphagotarsonemus latus) 等のホコリダニ類、ヒメハダニ類、ケナガハダニ類、フタトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis) 、ヤマトチマダニ (Haemaphysalis flava) 、タイワンカクマダニ (Dermacentor taiwanicus) 、ヤマトマダニ(Ixodes ovatus)、シュルツマダニ(Ixodes persulcatus) 、オウシマダニ(Boophilus microplus)等のマダニ類、ケナガコナダニ (Tyrophagus putrescentiae) 等のコナダニ類、コナヒョウヒダニ(Dermatophagoides farinae)、

ヤケヒョウヒダニ(Dermatophagoides ptrenyssnus)等のヒョウヒダニ類、ホソツメダニ(Cheyletus eruditus)、クワガタツメダニ(Cheyletus malaccensis)、ミナミツメダニ(Cheyletus moorei)等のツメダニ類、ワクモ類等。

クモ類:カバキコマチグモ (Chiracanthium japonicum) 、セアカゴケグモ (Lat rodectus hasseltii) 等。

[0029]

唇脚綱類:ゲジ (Thereuonema hilgendorfi) 、トビスムカデ (Scolopendra sub spinipes) 等。

倍脚綱類:ヤケヤスデ (Oxidus gracilis)、アカヤスデ (Nedyopus tambanus)等。

等脚目類:オカダンゴムシ (Armadillidium vulgare) 等。

腹足綱類:チャコウラナメクジ (Limax marginatus)、キイロコウラナメクジ (Limax flavus) 等。

線虫類:ミナミネグサレセンチュウ (Pratylenchus coffeae)、キタネグサレセンチュウ (Pratylenchus fallax)、ダイズシストセンチュウ (Heterodera glycines)、ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis)、キタネコブセンチュウ (Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita)等。

[0030]

本発明の有害生物防除剤は本発明化合物そのものでもよいが、通常は固体担体、液体担体及び又はガス状担体と混合し、更に必要に応じて界面活性剤その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、油剤、シャンプー剤、フロアブル剤、粉剤、水和剤、粒剤、ペースト状製剤、マイクロカプセル製剤、泡沫剤、エアゾール製剤、炭酸ガス製剤、錠剤、樹脂製剤等の形態に製剤化されたものである。これらの製剤は、毒餌、蚊取り線香、電気蚊取りマット、燻煙剤、燻蒸剤、シートに加工されて、使用されることもある。

これらの製剤は、本発明化合物を通常0.1~95重量%含有する。

[0031]

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類(カオリンクレー、

珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等)、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物(セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等)、化学肥料(硫安、燐安、硝安、塩安、尿素等)等の微粉末及び粒状物が挙げられる。

[0032]

液体担体としては、例えば芳香族または脂肪族炭化水素類(キシレン、トルエン、アルキルナフタレン、フェニルキシリルエタン、ケロシン、軽油、ヘキサン、シクロヘキサン等)、ハロゲン化炭化水素類(クロロベンゼン、ジクロロメタン、ジクロロエタン等)、アルコール類(メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、エチレングリコール等)、エーテル類(ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)、エステル類(酢酸エチル、酢酸ブチル等)、ケトン類(アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、ニトリル類(アセトニトリル、イソブチロニトリル等)、スルホキシド類(ジメチルスルホキシド等)、酸アミド類(N, Nージメチルホルムアミド、N, Nージメチルアセトアミド等)、植物油(大豆油、綿実油等)、植物精油(オレンジ油、ヒソップ油、レモン油等)および水などが挙げられる。

[0033]

ガス状担体としては、例えばブタンガス、フロンガス、液化石油ガス(LPG)、ジメチルエーテル、炭酸ガス等を挙げることができる。

[0034]

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類及び糖アルコール誘導体が挙げられる。

[0035]

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤及び安定剤等、具体的には例

えばカゼイン、ゼラチン、多糖類(澱粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等)、リグニン誘導体、ベントナイト、糖類、合成水溶性高分子(ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等)、PAP(酸性リン酸イソプロピル)、BHT(2,6-ジーtーブチルー4ーメチルフェノール)、BHA(2-tーブチルー4ーメトキシフェノールと3-tーブチルー4ーメトキシフェノールとの混合物)、植物油、鉱物油、脂肪酸及び脂肪酸エステルが挙げられる。

### [0036]

樹脂製剤の基材としては、例えば塩化ビニル系重合体、ポリウレタン等を挙げることができ、これらの基材には必要によりフタル酸エステル類(フタル酸ジメチル、フタル酸ジオクチル等)、アジピン酸エステル類、ステアリン酸等の可塑剤が添加されていてもよい。樹脂製剤は該基材中に化合物を通常の混練装置を用いて混練した後、射出成型、押出成型、プレス成型等により成型することにより得られ、必要により更に成型、裁断等の工程を経て、板状、フィルム状、テープ状、網状、ひも状等の樹脂製剤に加工できる。これらの樹脂製剤は、例えば動物用首輪、動物用イヤータッグ、シート製剤、誘引ひも、園芸用支柱として加工される。

## [0037]

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等が挙げられ、更に必要に応じて、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

## [0038]

本発明の有害生物防除剤は、例えば有害生物に直接、及び/または有害生物の 生息場所(植物体、動物体、土壌等)に施用することにより用いられる。

#### [0039]

本発明の有害生物防除剤を農林害虫の防除に用いる場合は、その施用量は有効成分量として通常1~10000g/ha、好ましくは10~1000g/ha

である。乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル製剤等は通常有効成分 濃度が1~10000ppmとなるように水で希釈して使用し、粉剤、粒剤等は 通常そのまま使用する。これらの製剤を有害生物から保護すべき植物に対して直接散布してもよい。これらの製剤を土壌に処理することにより土壌に棲息する有害生物を防除することもでき、またこれらの製剤を植物を植え付ける前の苗床に 処理したり、植付時に植穴や株元に処理することもできる。さらに、本発明の有害生物防除剤のシート製剤を植物に巻き付けたり、植物の近傍に設置したり、株元の土壌表面に敷くなどの方法でも施用することができる。

[0040]

本発明の有害生物防除剤を防疫用として用いる場合は、その施用量は空間に適用するときは有効成分量として通常  $0.001\sim10\,\mathrm{mg/m}^3$ であり、平面に適用するときは  $0.001\sim100\,\mathrm{mg/m}^2$ である。乳剤、水和剤、フロアブル剤等は通常有効成分濃度が  $0.01\sim10000\,\mathrm{ppm}$ となるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール、燻煙剤、毒餌等は通常そのまま施用する。

本発明の有害生物防除剤をウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ニワトリ用の家畜、イヌ、ネコ、ラット、マウス等の小動物の外部寄生虫防除に用いる場合は、獣医学的に公知の方法で動物に使用することができる。具体的な使用方法としては、全身抑制(systemic control)を目的にする場合には、例えば錠剤、飼料混入、坐薬、注射(筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等)により投与され、非全身的抑制(non-systemic control)を目的とする場合には、例えば油剤若しくは水性液剤を噴霧する、ポアオン(pour-on)処理若しくはスポットオン(spot-on)処理を行う、シャンプー製剤で動物を洗う又は樹脂製剤を首輪や耳札にして動物に付ける等の方法により用いられる。動物体に投与する場合の本発明化合物の量は、通常動物の体重1kgに対して、0.1~1000mgの範囲である。

[0041]

本発明の有害生物防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等と混用又は併用することもできる。

[0042]

かかる他の殺虫剤、殺ダニ剤の有効成分としては、例えば、アレスリン、テト ラメスリン、プラレトリン、フェノトリン、レスメトリン、シフェノトリン、ペ ルメトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ゼータシペルメトリン 、デルタメトリン、トラロメトリン、シフルトリン、ベータシフルトリン、シハ ロトリン、ラムダシハロトリン、フラメトリン、イミプロトリン、エトフェンプ ロクス、フェンバレレート、エスフェンバレレート、フェンプロパトリン、シラ フルオフェン、ビフェントリン、トランスフルスリン、フルシトリネート、タウ フルバリネート、アクリナトリン、テフルトリン等のピレスロイド化合物、ジク ロルボス、フェニトロチオン、シアノホス、プロフェノホス、スルプロホス、フ ェントエート、イソキサチオン、テトラクロロビンホス、フェンチオン、クロル ピリホス、ダイアジノン、アセフェート、テルブホス、フォレート、クロルエト キシホス、ホスチアゼート、エトプロホス、カズサホス、メチダチオン等の有機 **燐化合物、プロポキサー、カルバリル、メトキサジアゾン、フェノブカルブ、メ** ソミル、チオジカルブ、アラニカルブ、ベンフラカルブ、オキサミル、アルジカ ルブ、メチオカルブ等のカーバメート化合物、ルフェヌロン、クロルフルアズロ ン、ヘキサフルムロン、ジフルベンズロン、トリフルムロン、テフルベンズロン 、フルフェノクスロン、フルアズロン、ノバルロン、トリアズロン等のベンゾイ ルフェニルウレア化合物、ピリプロキシフェン、メトプレン、ハイドロプレン、 フェノキシカルブ等の幼若ホルモン様物質、アセタミプリド、ニテンピラム、チ アクロプリド、チアメトキサム、ジノテフラン等のネオニコチノイド系化合物、 アセトプロール、エチプロール等のN-フェニルピラゾール系化合物、テブフェノ ジド、クロマフェノジド、メトキシフェノジド、ハロフェノジド等のベンゾイル ヒドラジン化合物、ジアフェンチウロン、ピメトロジン、フロニカミド、トリア ザメート、ブプロフェジン、スピノサド、エマメクチン安息香酸塩、クロルフェ ナピル、インドキサカルブMP、ピリダリル、シロマジン、フェンピロキシメート 、テブフェンピラド、トルフェンピラド、ピリダベン、ピリミジフェン、フルア **クリピリム、エトキサゾール、フェナザキン、アセキノシル、ヘキシチアゾクス** 、クロフェンテジン、酸化フェンブタスズ、ジコホル、プロパルギット、エバー **メクチン、ミルベメクチン、アミトラズ、カルタップ、ベンスルタップ、チオシ**  クラム、エンドスルファン、スピロジクロフェン、スピロメシフェン及びアザジ ラクチンがあげられる。

[0043]

かかる他の殺菌剤の有効成分としては、例えば、アゾキシストロビン等のストロビルリン化合物、トリクロホスメチル等の有機リン化合物、トリフルミゾール、ペフラゾエート、ジフェノコナゾール等のアゾール化合物、フサライド、フルトラニル、バリダマイシン、プロベナゾール、ジクロメジン、ペンシクロン、ダゾメット、カスガマイシン、IBP、ピロキロン、オキソリニック酸、トリシクラゾール、フェリムゾン、メプロニル、EDDP、イソプロチオラン、カルプロパミド、ジクロシメット、フラメトピル、フルジオキソニル、プロシミドン及びジエトフェンカルブがあげられる。

. [0044]

# 【実施例】

以下、本発明を製造例、製剤例および試験例によりさらに詳しく説明するが、 本発明は、これらの例のみに限定されるものではない。まず、本発明化合物の製 造例を示す。

[0045]

#### 製造例1

((6-クロロー3-ピリジル)メチル)マロノニトリル58mgをN,Nージメチルホルムアミド2mlに溶解し、氷冷下撹拌しながら水素化ナトリウム(60%油性)14mgを加えた。その後、臭化アリル0.13mlを滴下し、さらに室温で一晩撹拌した。反応混合物に10%塩酸を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を10%塩酸および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下式で示される2-アリルー2-((6-クロロー3-ピリジル)メチル)マロノニトリル

(以下、本発明化合物 (1) と記す。) 26 mgを得た。

収率 37%

n<sub>D</sub><sup>22.5</sup> 1.5380

[0046]

#### 製造例2

窒素雰囲気下で、((6-クロロ-3-ピリジル)メチリデン)マロノニトリル0.50g、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム・クロロホルム 錯体70mgおよび1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン0.1 5gをテトラヒドロフラン13m1中に加え、さらにアリルクロライド0.41g、トリメチルシリルシアニド0.53gを加え、75℃で一日間攪拌した。その後、反応混合物をシリカゲルを通して濾過し、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付して、下式で示される1-((6-クロロ-3-ピリジル)-1,2,2-トリシアノー4ーペンテン

(以下、本発明化合物(2)と記す。) 0.48gを得た。

# 収率 71%

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm)): 2. 99 (1H, dd), 3. 11 (1H, dd), 4. 30 (1H, s), 5. 58~5. 68 (2H, m), 5. 85~6. 07 (1H, m), 7. 54 (1H, d), 7. 96 (1H, dd), 8. 54 (1H, d)

[0047]

#### 製造例3

(3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル)マロノニトリル0.21g、N , N-ジメチルホルムアミド5m1、水素化ナトリウム(60%油性)0.05 gおよび3-プロモメチル-6-クロロピリジン0.28gを用い製造例1記載の方法に準じて、下式で示される2-((6-クロロ-3-ピリジル)メチル)-2-(3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル)マロノニトリル

(本発明化合物 (3)) 0.22gを得た。

# 収率61%

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm) : 2. 22~2. 27 (2H, m), 2.  $70\sim2$ . 80 (2H, m), 3. 26 (2H, s), 7. 43 (1 H, d), 7. 74 (1H, dd), 8. 41 (1H, d)

[0048]

#### 製造例4

(3,3,3-トリフルオロロプロピル) マロノニトリル0.6g及び2-ク ロロ-5-クロロメチルピリジンO. 6gをN, N-ジメチルホルムアミド15 m1に溶解し、炭酸カリウム O. 51gを加え、室温で一晩攪拌した。その後、 反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次 洗浄し無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラム クロマトグラフィーに付し、下式で示される2-((6-クロロー3-ピリジル ) メチル) -2-(3,3,3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル

(以下、本発明化合物(4)と記す。) 0. 62gを得た。

# 収率 58%

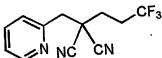
 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13, TMS,  $\delta$  (ppm)):2.25~2.35(2H , m), 2. 51~2. 60 (2H, m), 3. 27 (2H, s), 7. 44 ( 1H, d), 7. 74 (1H, dd), 8. 42 (1H, d)

[0049]

#### 製造例5

2- (クロロメチル) ピリジン塩酸塩303mgをN, N-ジメチルホルムア ミド3m1に懸濁し、炭酸カリウム256mgを加えて攪拌した。次に(3,3

, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル300mgをN, Nージメチルホ ルムアミド3m1に溶解した溶液を加え、さらに炭酸カリウム256mgを加え て室温で一晩攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層 を水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧 下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下式で示され る2-((2-ピリジル)メチル)-2-(3,3,3-トリフルオロプロピル ) マロノニトリル



(以下、本発明化合物 (5) と記す。) 270mgを得た。

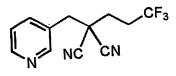
収率 58%

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13, TMS,  $\delta$  (ppm)):2.33~2.37 (2H , m), 2.  $54\sim2$ . 65 (2H, m), 3. 47 (2H, s), 7.  $31\sim$ 7. 37 (2H, m), 7. 74 $\sim$ 7. 78 (1H, m), 8. 64 $\sim$ 8. 66 (1 H, m)

[0050]

### 製造例6

(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル407mgをN, N-ジメチルホルムアミド 5 m 1 に溶解し、炭酸カリウム 3 4 7 mgを加え、さらに 3 - (クロロメチル) ピリジン320mgをN, N-ジメチルホルムアミド1m 1に溶解した溶液を滴下し、室温で一晩攪拌した。その後、反応混合物に水を加 え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫 酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ トグラフィーに付し、下式で示される2-((3-ピリジル)メチル)-2-( 3, 3, 3ートリフルオロプロピル) マロノニトリル



(以下、本発明化合物(6)と記す。) 400mgを得た。

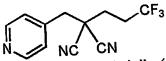
# 収率 63%

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13, TMS,  $\delta$  (ppm) : 2. 25~2. 29 (2H, m), 2.  $51\sim2$ . 62 (2H, m), 3. 29 (2H, s), 7.  $38\sim7$ . 42 (1H, m), 7. 76~7. 79 (1H, m), 8. 64 (1H, d) , 8. 70 (1H, dd)

[0051]

#### 製造例7

(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル401mg、N, N-ジメチルホルムアミド6m1、炭酸カリウム0.68gおよび4-(クロロメチ ル) ピリジン406mgを用い製造例7記載の方法に準じて、下式で示される2 - (4-ピリジルメチル) -2- (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノ . . ニトリル



(以下、本発明化合物(7)と記す。) 500mgを得た。

## 収率 80%

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm)): 2. 25~2. 29 (2H) .m), 2. 49~2. 62 (2H, m), 3. 25 (2H, s), 7. 33 ( 2H, dd), 8.72(2H, dd)

[0052]

#### 製造例8

(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル226mg、N, N-ジ メチルホルムアミド5m1、炭酸カリウム193mgおよび2ー(ブロモメチル ) -6-クロロピリジン335mgを用い製造例7記載の方法に準じて、下式で 示される2- ((6-クロロ-2-ピリジル) メチル) -2- (3, 3, 3-ト リフルオロプロピル) マロノニトリル

(本発明化合物(8))365mgを得た。

# 収率 91%

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm)):2.33~2.37 (2H , m), 2.54~2.65(2H, m), 3.43(2H, s), 7.32( 1H, d), 7.38 (1H, d), 7.74 (1H, dd)

[0053]

## 製造例9

(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル83mg、N, N-ジ メチルホルムアミド10m1、炭酸カリウム71mgおよび3-(クロロメチル ) -6- (トリフルオロメチル) ピリジン100mgを用い製造例7記載の方法 に準じて、下式で示される2-((6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル ) メチル) -2-(3, 3, 3 -トリフルオロプロピル)マロノニトリル

(以下、本発明化合物 (9) と記す。) 130 mgを得た。

# 収率 79%

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm) : 2. 29~2. 34 (2H, m), 2. 53~2. 68 (2H, m), 3. 36 (2H, s), 7. 79 (1 H, d), 7. 98 (1H, dd), 8. 76 (1H, d)

[0054]

次に、中間体化合物の製造例を参考製造例として示す。

# 参考製造例1

((6-クロロ-3-ピリジル)メチリデン)マロノニトリル

0.18gをエタノール1m1に溶解し、室温で撹拌しながら水素化ホウ素ナト リウム40mgをエタノール1m1に懸濁した溶液を滴下した。室温で30分間 撹拌した後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽 出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、((6-クロロ-3-ピリジル)メチル)マロノニトリル(中間体(1)) 0. 12gを得た。

収率 66%

[0055]

# 参考製造例2

マロノニトリル 6.98g、テトラブチルアンモニウムブロマイド 681 mg および4 - ブロモー1, 1, 2 - トリフルオロー1 - ブテン10.0gを混合し、窒素雰囲気下0℃で攪拌しながら t - ブトキシカリウム 5.92gを加え、室温で12時間攪拌した。その後、反応混合物を水に加え、t - ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、(3, 4, 4 - トリフルオロー3 - ブテニル)マロノニトリル(中間体(2))1.31gを得た。

収率14%

[0056]

# 参考製造例3

マロノニトリル27.6gをN, Nージメチルホルムアミド50m1に溶解し、室温で炭酸カリウム27.6gを加えた。この反応混合物を1時間攪拌した後、N, Nージメチルホルムアミド20m1に溶解した1ーブロモー3,3,3ートリフルオロプロパン17.7gを滴下し、さらに1時間攪拌した。その後、反応混合物に水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、(3,3,3ートリフルオロプロピル)マロノニトリル(中間体(3))11.3gを得た。

収率 68%

[0057]

次に、化合物の製造に用いた中間体化合物を化合物番号および物性値と共に示

す。

[0058]

中間体(1)

((6-クロロ-3-ピリジル)メチル)マロノニトリル

mp. 63.0℃

[0059]

中間体(2)

(3, 4, 4-トリフルオロー3-ブテニル) マロノニトリル

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm)):1.18~1.28 (1H, m), 2.27~2.34 (2H, m), 2.58~2.72 (2H, m), 3.88 (1H, t)

[0060]

中間体(3)

(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) マロノニトリル

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>, TMS,  $\delta$  (ppm)): 2. 32~2. 42 (2H, m), 2. 43~2. 52 (2H, m), 3. 91 (1H, t)

[0061]

次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。また、本発明化合物は前記の化 合物番号で表す。

[0062]

製剤例1

本発明化合物(1)~(9)9部を、キシレン37.5部およびジメチルホルムアミド37.5部に溶解し、これにポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル10部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム6部を加え、よく攪拌混合して乳剤を得る。

[0063]

#### 製剤例2.

本発明化合物(1)~(9) 40部にソルポール5060(東邦化学登録商標名)5部を加え、よく混合して、カープレックス#80(塩野義製薬登録商標名、合成含水酸化ケイ素微粉末)32部、300メッシュ珪藻土23部を加え、ジュースミキサーで混合して、水和剤を得る。

[0064]

#### 製剤例3

本発明化合物 (1) ~ (9) 3部、合成含水酸化珪素微粉末5部、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム5部、ベントナイト30部およびクレー57部を加え、よく攪拌混合し、ついでこれらの混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、増粒機で製粒し、通風乾燥して粒剤を得る。

[0065]

#### 製剤例4

本発明化合物(1)~(9)4.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、凝集剤としてドリレスB(三共社製)1部、クレー7部を乳鉢でよく混合した後にジュースミキサーで攪拌混合する。得られた混合物にカットクレー86.5部を加えて、充分攪拌混合し、粉剤を得る。

[0066]

#### 製剤例5

本発明化合物(1)~(9)10部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩50部を含むホワイトカーボン35部及び水55部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕することにより、製剤を得る。

[0067]

#### 製剤例6

# 特2002-208059

本発明化合物(1)~(9) 0.5部をジクロロメタン10部に溶解し、こ れをアイソパーM (イソパラフィン:エクソン化学登録商標名) 89. 5部に混 合して油剤を得る。

[0068]

### 製剤例7

本発明化合物(1)~(9) 0.1部、ネオチオゾール(中央化成株式会社 ) 49.9部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、25部の ジメチルエーテル及び25部のLPGを充填し、振とうを加え、アクチュエータ を装着することにより油性エアゾールを得る。

[0069]

#### 製剤例8

本発明化合物(1)~(9) 0.6部、BHT0.01部、キシレン5部、 脱臭灯油3.39部および乳化剤(アトモス300(アトモスケミカル社登録商 標名)} 1部を混合溶解したものと、蒸留水50部とをエアソール容器に充填し 、バルブ部分を取り付け、該バルブを通じて噴射剤(LPG)40部を加圧充填 して、水性エアゾールを得る。

[0070]

次に、本発明化合物が有害生物防除組成物の有効成分として有効であることを 試験例により示す。なお、本発明化合物は前記の化合物番号で表す。

[0071]

#### 試験例1

製剤例5により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が500ppmとな るように希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップに培土ボンソル2号(住友化学工業(株)製)50 gを入れて種子を10~15粒播種し、第2本葉が展開するまで生育させた後、 高さを5cmに切り揃えたイネに対し、上記のように調製した試験用薬液を20m 1/カップの割合で散布した。イネに散布処理された薬液が乾燥した後、供試虫 逃亡防止のためのプラスチックカップに入れ、トビイロウンカの初齢幼虫を30 頭放して蓋をし、その後温室内〈25℃〉に静置した。トピイロウンカの幼虫を 放してから6日後に当該イネに寄生するトビイロウンカの数を調査した。

その結果、本発明化合物(3)、(4)、(5)、(7)、(8)及び(9) の処理において、寄生する虫数は3頭以下であった。

[0072]

#### 試験例2

製剤例5により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップにキュウリを植え、第1本葉が展開するまで生育させ、そこにワタアブラムシ約20頭を寄生させた。1日後、そのキュウリに上記の試験用薬液を20m1/カップの割合で散布した。散布6日後にワタアブラムシの数を調査した。

その結果、本発明化合物(4)、(8)及び(9)の処理においては各々処理 6日後に寄生する虫数は3頭以下であった。

[0073]

#### 試験例3

製剤例5により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

直径5.5 cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mlを濾紙上に滴下し、餌としてショ糖30mgを均一に入れた。該ポリエチレンカップ内にイエバエ (Musca domestica) 雌成虫10頭を放ち、蓋をした。24時間後にイエバエの生死を調査し死虫率を求めた。

その結果、本発明化合物(1)、(2)、(4)、(8)及び(9)の処理に おいては死虫率90%以上を示した。

[0074]

### 試験例4

製剤例5により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

直径5.5cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mlを濾紙上に滴下し、餌としてショ糖30mgを均一に入れた。該ポ

リエチレンカップ内にチャバネゴキブリ(Blattalla germanica)雄成虫2頭を放ち、蓋をした。6日後にチャバネゴキブリの生死を調査し死虫率を求めた。

その結果、本発明化合物(1)、(4)、(8)及び(9)の処理においては 死虫率100%を示した。

[0075]

#### 試験例5

製剤例5により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

上記試験用薬液 0.7mlをイオン交換水100mlに加えた(有効成分濃度 3.5ppm)。該液中にアカイエカ(Culex pipiens pallens) 終令幼虫20頭を放ち、1日後にその生死を調査し死虫率を求めた。

その結果、本発明化合物 (3)、 (4)、 (8) 及び (9) の処理においては 死虫率100%を示した。

[0076]

## 【発明の効果】

本発明化合物は、優れた有害生物防除効力を有することから、有害生物防除剤の有効成分として有用である。

【書類名】 要約書

【要約】

#### 【課題】

優れた有害生物防除活性を有する化合物及び該化合物の有害生物防除用途を提供すること。

#### 【解決手段】

式(I)

$$(R^5)_n \xrightarrow{R^1 \quad R^2 \quad R^3} R^4 \qquad (1)$$

[式中、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は水素原子等を表す。

 $R^3$ 及び $R^4$ は、同一または相異なり、各々C1~C6(ハロ)アルキル基、C2 ~C6(ハロ)アルケニル基等を表す。

R<sup>5</sup>は、ハロゲン原子等を表す。

nは0~4の任意の整数を表す。]

で示されるマロノニトリル化合物、前記マロノニトリル化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤及び前記マロノニトリル化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用することを特徴とする有害生物防除法。

【選択図】 なし

# 出願人履歴情報

識別番号

[000002093]

1. 変更年月日

1990年 8月28日

[変更理由]

新規登録

住 所

大阪府大阪市中央区北浜4丁目5番33号

氏 名

住友化学工業株式会社